

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005 年 3 月 10 日 (10.03.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/021534 A1(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 403/04, A61K  
31/404, A61P 1/00, 1/14, 3/00, 7/02, 9/00, 9/12, 17/14,  
25/08, 25/14, 25/16, 25/22, 25/24, 25/28, 25/30, 29/00,  
37/02, 43/00, C07M 7/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/012398

(22) 国際出願日: 2004 年 8 月 27 日 (27.08.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2003-209401 2003 年 8 月 28 日 (28.08.2003) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大正製薬株式会社 (TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.)  
[JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 熊谷 利仁 (KUMAGAI, Toshihito) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). ▲くわ▼田 剛志 (KUWADA, Takeshi) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 柴田 剛 (SHIBATA, Tsuyoshi) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 林 真知 (HAYASHI, Masato) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島

区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 藤澤 由合 (FUJISAWA, Yuri) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 関口 喜功 (SEKIGUCHI, Yoshinori) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 佐島 宗一, 外 (SATORI, Soichi et al.); 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社 知的財産部内 Tokyo (JP).

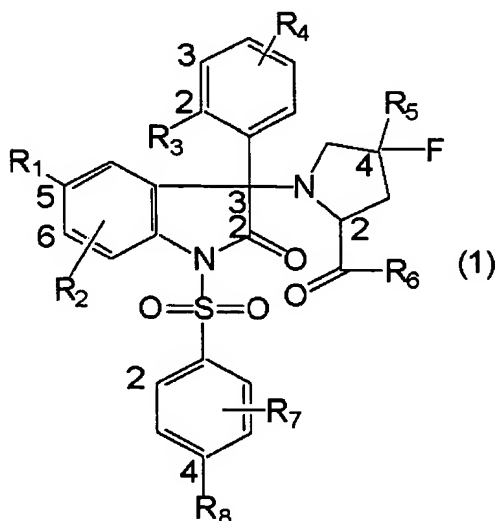
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[続葉有]

(54) Title: 1,3-DIHYDRO-2H-INDOL-2-ONE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 1, 3-ジヒドロ-2H-インドール-2-オン誘導体

(57) Abstract: A novel compound which is a 1,3-dihydro-2H-indol-2-one derivative represented by the formula (1): (1) (wherein R<sub>1</sub> represents halogeno, C<sub>1-4</sub> alkyl, etc. and R<sub>2</sub> represents hydrogen, halogeno, etc., or R<sub>2</sub> is present in the 6-position of the indol-2-one and is bonded to R<sub>1</sub> to form C<sub>3-6</sub> alkylene; R<sub>3</sub> represents halogeno, hydroxy, etc. and R<sub>4</sub> represents hydrogen, halogeno, C<sub>1-4</sub> alkyl, etc., or R<sub>4</sub> is present in the 3-position of the phenyl and is bonded to R<sub>3</sub> to form methylenedioxy; R<sub>5</sub> represents hydrogen or fluorine; R<sub>6</sub> represents ethylamino, dimethylamino, etc.; R<sub>7</sub> represents C<sub>1-4</sub> alkoxy; and R<sub>8</sub> represents C<sub>1-4</sub> alkoxy) or a pharmaceutically acceptable salt of the derivative. The compound has antagonistic activity against an arginine-vasopressin V1b receptor.

[続葉有]

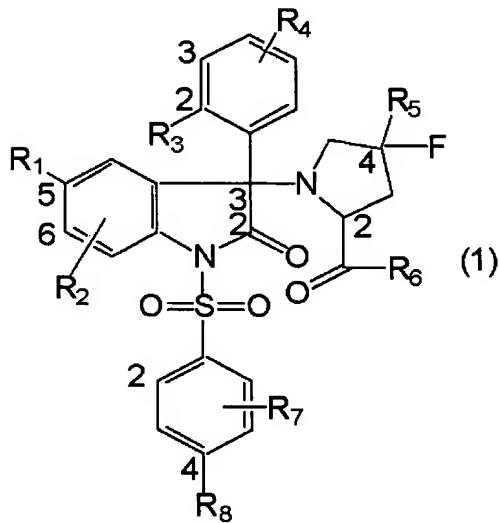


添付公開書類：  
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

式(1)



(式中、 $R_1$  は、ハロゲン原子、炭素原子数1〜4のアルキル基等、 $R_2$  は、水素原子、ハロゲン原子等、又は $R_2$  がインドール-2-オンの6位にあり、かつ $R_1$  と $R_2$  は一緒になって炭素原子数3〜6のアルキレン基を形成する基を示し、 $R_3$  は、ハロゲン原子、ヒドロキシル基等、 $R_4$  は、水素原子、ハロゲン原子、炭素原子数1〜4のアルキル基等、又は $R_4$  がフェニルの3位にあり、かつ $R_3$  と $R_4$  は一緒になってメチレンジオキシ基を示し、 $R_5$  は、水素原子又はフッ素原子を示し、 $R_6$  は、エチルアミノ基、ジメチルアミノ基等、 $R_7$  は、炭素原子数1〜4のアルコキシ基を示し、 $R_8$  は、炭素原子数1〜4のアルコキシ基を示す。)で表される1, 3-ジヒドロ-2H-インドール-2-オン誘導体又はその医薬上許容される塩あり、アルギニン-パソプレッシンV1b受容体拮抗作用を有する新規な化合物である。